

(12) 按照专利合作条约所公布的国际申请

(19) 世界知识产权组织  
国际局



(43) 国际公布日:  
2005年6月9日(09.06.2005)

PCT

(10) 国际公布号:  
WO 2005/051959 A1

(51) 国际分类号<sup>7</sup>: C07D 499/08, 501/20, A61K 31/43, A61P 31/00

(21) 国际申请号: PCT/CN2004/001318

(22) 国际申请日: 2004年11月19日(19.11.2004)

(25) 申请语言: 中文

(26) 公布语言: 中文

(30) 优先权:  
200310108979.6 2003年11月28日(28.11.2003) CN  
200410083434.9 2004年9月29日(29.09.2004) CN

(71) 申请人(对除美国以外的所有指定国): 浙江永宁制药厂(ZHEJIANG YONGNING PHARMACEUTICAL FACTORY) [CN/CN]; 中国浙江省台州市黄岩梅花井路4号, Zhejiang 318020 (CN)。

(72) 发明人:及

(75) 发明人/申请人(仅对美国): 叶风起(YE, Fengqi) [CN/CN]; 方善综(FANG, Shanzong) [CN/CN]; 陆修伟(LU, Xiuwei) [CN/CN]; 中国浙江省台州市黄岩梅花井路4号, Zhejiang 318020 (CN)。

(74) 代理人: 上海智信专利代理有限公司(SHANGHAI ZHI XIN PATENT AGENT LTD.); 中国上海市肇嘉浜路446号伊泰利大厦10楼, Shanghai 200031 (CN)。

(81) 指定国(除另有指明, 要求每一种可提供的国家保护): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BW,

BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NA, NI, NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW

(84) 指定国(除另有指明, 要求每一种可提供的地区保护): ARIPO(BW, GH, GM, KE, LS, MW, MZ, NA, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), 欧亚专利(AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), 欧洲专利(AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IS, IT, LU, MC, NL, PL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI(BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG)

根据细则4.17的声明:

- 关于申请人在国际申请日有权申请并被授予专利(细则4.17(ii))对除美国以外的所有指定国
- 关于申请人在国际申请日有权要求该在先申请的优先权(细则4.17(iii))对除美国以外的所有指定国
- 发明人资格(细则4.17(iv))仅对美国

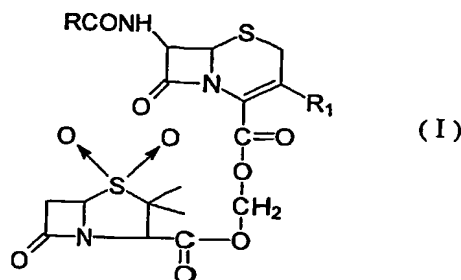
本国际公布:

- 包括国际检索报告。

所引用双字母代码和其它缩写符号, 请参考刊登在每期PCT公报期刊起始的“代码及缩写符号简要说明”。

(54) Title:  $\beta$ -LACTAMASE-RESISTANT CEPHALOSPORIN ESTER COMPOUNDS AND SALTS OF THEREOF

(54) 发明名称: 耐 $\beta$ -内酰胺酶的头孢菌素酯化合物及其盐



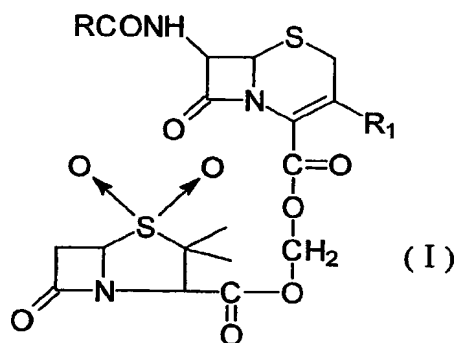
(57) Abstract: The present invention discloses the  $\beta$ -lactamase-resistant cephalosporin ester compounds represented by the following formula (I), characterized in that the structures of the compounds are composed by connecting methyl ester residue of subactam halomethyl ester with carboxyl residue of semi-synthetic cephalosporins or salts of thereof. The present invention also provides the pharmaceutical salts of thereof, and the use of thereof in preparation of oral antibiotics.

[见续页]



## (57) 摘要

本发明公开了一种耐 $\beta$ -内酰胺酶的头孢菌素酯化合物，其特征在于该化合物的结构式由舒巴坦卤甲酯的甲酯残基与半合成头孢菌素或其盐的羧基残基相连接构成，如结构式(I)所示：



本发明还提供了该化合物的药用盐，以及它们在制备口服抗生素中的应用。